

[19]中华人民共和国专利局

[51]Int.Cl<sup>6</sup>

A61K 31/35

A61K 31/70



# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 97104831.2

[43]公开日 1997 年 11 月 19 日

[11] 公开号 CN 1164999A

[22]申请日 97.3.21

[30]优先权

[32]96.3.22 [33]JP[31]066102/96

[32]97.1.14 [33]JP[31]004575/97

[71]申请人 大日本油墨化学工业株式会社

地址 日本东京

[72]发明人 高垣秀次 木村信之 青木康夫

中西慈典 阿部真好 三角修

[74]专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标  
事务所

代理人 段承恩

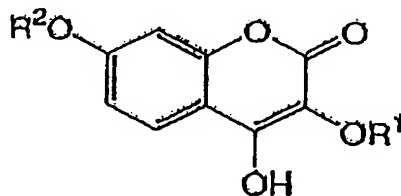
权利要求书 5 页 说明书 30 页 附图页数 0 页

[54]发明名称 苯并吡喃衍生物和将其作为有效成分的  
心脏病治疗药

[57]摘要

本发明目的在于提供低毒而且对局部缺血性心脏病和心律不齐等心脏病有很好治疗效果的心脏病治疗药物以及用于该治疗药的新的苯并吡喃衍生物。即提供以通式(I)表示的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐作为有效成分的心脏病治疗药物

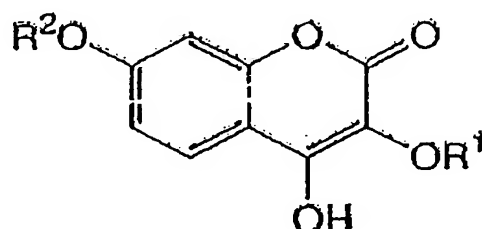
(式中, R<sup>1</sup> 为烷基或者是链烯基、R<sup>2</sup> 为氢原子、烷基、含有羟基的烷基、链烯基、酰基或者是糖基)。



(BJ)第 1456 号

# 权 利 要 求 书

1. 以用通式 (I) 表示的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐为有效成分的心脏病治疗药,



(式中, R<sup>1</sup> 为烷基或链烯基, R<sup>2</sup> 为氢原子、烷基、含有羟基的烷基、链烯基、酰基或糖基)。

2. 权利要求 1 中记载的以苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类为有效成分的心脏病治疗药, 其中的 R<sup>1</sup> 是碳数为 1 - 10 的烷基或者是碳数为 2 - 10 的链烯基, R<sup>2</sup> 为氢原子、碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基、碳数为 1 - 10 的酰基、或者是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

3. 权利要求 1 中记载的以苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类为有效成分的心脏病治疗药, 其中 R<sup>1</sup> 是碳数为 1 - 10 的烷基。

4. 权利要求 2 中记载的以苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类为有效成分的心脏病治疗药, 其中 R<sup>1</sup> 是碳数为 1 - 10 的烷基。

5. 权利要求 1 中记载的以苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类为有效成分的心脏病治疗药, 其中 R<sup>2</sup> 是氢原子。

6. 权利要求 2 中记载的以苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类为有效成分的心脏病治疗药, 其中 R<sup>2</sup> 是氢原子。

7. 权利要求 3 中记载的以苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类为有效成分的心脏病治疗药, 其中 R<sup>2</sup> 是氢原子。

8. 权利要求 1 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的

盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基。

9. 权利要求 2 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基。

10. 权利要求 3 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基。

11. 权利要求 1 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的酰基。

12. 权利要求 2 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的酰基。

13. 权利要求 3 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的酰基。

14. 权利要求 1 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

15. 权利要求 2 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

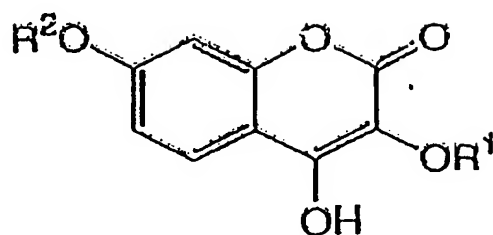
16. 权利要求 3 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

17. 权利要求 14 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是葡萄糖基。

18. 权利要求 15 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是葡萄糖基。

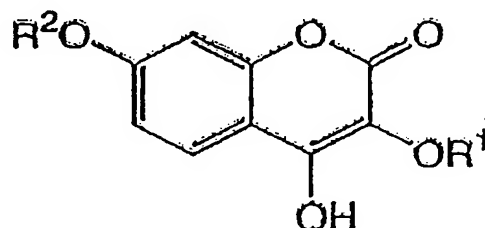
19. 权利要求 16 中记载的以苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物盐类为有效成分的心脏病治疗药，其中  $R^2$  是葡萄糖基。

20. 以通式 (II) 表示的苯并吡喃衍生物，



(式中,  $R^1$  为碳数 1 - 10 的烷基、或碳数为 2 - 10 的链烯基,  $R^2$  为含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基)。

21. 通式 (I) 表示的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类用于制备心脏病治疗药,



(式中,  $R^1$  为烷基或链烯基,  $R^2$  为氢原子、烷基、含有羟基的烷基、链烯基、酰基或糖基)。

22. 权利要求 21 中记载的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中的  $R^1$  是碳数为 1 - 10 的烷基或者是碳数为 2 - 10 的链烯基,  $R^2$  为氢原子、碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基、碳数为 1 - 10 的酰基、或者是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

23. 权利要求 21 中记载的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^1$  是碳数为 1 - 10 的烷基。

24. 权利要求 22 中记载的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^1$  是碳数为 1 - 10 的烷基。

25. 权利要求 21 中记载的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是氢原子。

26. 权利要求 22 中记载的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是氢原子。

27. 权利要求 23 中记载的苯并吡喃衍生物或者生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是氢原子。

28. 权利要求 21 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基。

29. 权利要求 22 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基。

30. 权利要求 23 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的烷基、含有羟基的碳数为 2 - 4 的烷基、碳数为 2 - 10 的链烯基。

31. 权利要求 21 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的酰基。

32. 权利要求 22 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的酰基。

33. 权利要求 23 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是碳数为 1 - 10 的酰基。

34. 权利要求 21 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

35. 权利要求 22 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药 方面的用途, 其中  $R^2$  是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

36. 权利要求 23 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是从葡萄糖基、甘露糖基、半乳糖基组成的一组糖基中选择的糖基。

37. 权利要求 34 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是葡萄糖基。

38. 权利要求 35 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是葡萄糖基。

39. 权利要求 36 中记载的苯并吡喃或生理学上容许的该衍生物的盐类在制备心脏病治疗药方面的用途, 其中  $R^2$  是葡萄糖基。